

TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

PCT

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

Referencia del expediente del solicitante o del mandatario	PARA ACCIÓN	Véase la notificación de transmisión del informe de examen preliminar internacional (formulario PCT/IPEA/416)
Solicitud internacional N° PCT/MX2003/000054	Fecha de presentación internacional (día/mes/año) 10 julio 2003 (10.07.2003)	Fecha de prioridad (día/mes/año)
Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o a la vez clasificación nacional e IPC A61K 31/5415, A61K 9/08		
Solicitante JIMÉNEZ BAYARDO, ARTURO		

1. El presente informe de examen preliminar internacional, emitido por la Administración encargada del examen preliminar internacional, se transmite al solicitante conforme al Artículo 36.

2. Este INFORME comprende **4** hojas, incluida la presente hoja de portada.

☒ Está acompañado de ANEXOS, es decir, de hojas de la descripción, las reivindicaciones o los dibujos que han sido modificados y que sirven de base al presente informe o de hojas que contienen rectificaciones efectuadas ante la Administración encargada del examen preliminar internacional (véase la Regla 70.16 y la Instrucción 607 de las Instrucciones Administrativas del PCT).

Esos anexos comprenden **2** hojas.

3. El presente informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes:

- I ☒ Base del informe
- II ☐ Prioridad
- III ☐ Falta de formulación de opinión sobre la novedad, la actividad inventiva y la posibilidad de aplicación industrial
- IV ☐ Falta de unidad de invención
- V ☒ Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la posibilidad de aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración
- VI ☐ Ciertos documentos citados
- VII ☐ Defectos en la solicitud internacional
- VIII ☒ Observaciones relativas a la solicitud internacional

Fecha de presentación de la solicitud de examen preliminar internacional 6 febrero 2005 (06.02.2005)	Fecha de finalización del presente informe 4 octubre 2005 (04.05.2005)
Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional OEPM C/ Panamá 1, 28071 Madrid	Funcionario autorizado A. Colomer Nieves Nº de teléfono: +34 91 3495542
Nº de telecopiador	

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional N°
PCT/MX2003/000054

I. Base de la opinión

1. Por lo que respecta a los **elementos** de la solicitud internacional*:

- ☐ La solicitud internacional tal como se presentó inicialmente
- ☒ la descripción:
 Páginas **1- 7**, tal como se presentaron inicialmente
 páginas, presentadas con la solicitud de examen preliminar internacional
 páginas, presentadas con una carta fechada el __/__/__
- ☒ las reivindicaciones:
 páginas, tal como se presentaron inicialmente
 páginas, modificadas (acompañadas, en su caso, de una declaración) según el Artículo 19
 Páginas **8-9**, presentadas con la solicitud de examen preliminar internacional
 páginas, presentadas con una carta fechada el __/__/__
- ☐ los dibujos:
 páginas, tal como se presentaron inicialmente
 páginas, presentadas con la solicitud de examen preliminar internacional
 páginas, presentadas con una carta fechada el __/__/__
- ☐ la parte de la descripción reservada a la lista de secuencias:
 páginas, tal como se presentaron inicialmente
 páginas, presentadas con la solicitud de examen preliminar internacional
 páginas, presentadas con una carta fechada el __/__/__

2. Por lo que respecta al **idioma**, todos los elementos indicados a continuación estaban a disposición de la Administración o se le han entregado en el idioma de presentación de la solicitud internacional, salvo que en este punto se indique otra cosa.
 Esos elementos estaban a disposición de la Administración o se le han entregado en el idioma siguiente que es:

- ☐ el idioma de una traducción entregada a los fines de la búsqueda internacional (según la Regla 23.1.b)).
- ☐ el idioma de publicación de la solicitud internacional (según la Regla 48.3.b)).
- ☐ el idioma de la traducción entregada a los fines del examen preliminar internacional (según la Regla 55.2 ó 55.3).

3. Por lo que respecta a las **secuencias de nucleótidos o de aminoácidos** divulgadas en la solicitud internacional, la opinión escrita se ha formulado sobre la base de la lista de secuencias:

- ☐ contenida en la solicitud internacional, en forma escrita.
- ☐ presentada con la solicitud internacional, en forma legible por ordenador.
- ☐ entregada posteriormente a la Administración, en forma escrita.
- ☐ entregada posteriormente a la Administración, en forma legible por ordenador.
- ☐ Ha sido entregada la declaración, según la cual la lista de secuencias presentada por escrito y entregada posteriormente no va más allá de la divulgación contenida en la solicitud tal como fue presentada.
- ☐ Ha sido entregada la declaración, según la cual las informaciones grabadas en forma legible por ordenador son idénticas a las de la lista de secuencias presentada por escrito.

4. ☐ Las modificaciones han ocasionado la anulación:

- ☐ de la descripción, páginas
- ☐ de las reivindicaciones, Nos.
- ☐ de los dibujos, hojas/fig.

5. ☐ La presente opinión ha sido formulada como si no se hubiesen presentado (algunas) de las modificaciones, que se ha considerado que iban más allá de la exposición de la invención tal como fue presentada, como se indica en el recuadro suplementario (Regla 70.2.c)).

* Las hojas de reemplazo entregadas a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento efectuado según el Artículo 14 se consideran en el presente informe como "inicialmente presentadas".

INFORME DE EXAMEN PRELIMINAR INTERNACIONAL

Solicitud internacional N°

PCT/MX2003/000054
V. Declaración motivada según la Regla 66.2.a)ii) sobre la novedad, la actividad inventiva y la posibilidad de aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración
1. Declaración

Novedad	Reivindicaciones 1-9	SÍ
	Reivindicaciones	NO
Actividad inventiva	Reivindicaciones 1-5	SÍ
	Reivindicaciones 6-9	NO
Posibilidad de aplicación industrial	Reivindicaciones 1-9	SÍ
	Reivindicaciones	NO

2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)

La presente solicitud se refiere a un método para solubilizar meloxicam que comprende las operaciones de mezclar previamente alcohol etílico y metilidenglicerol; agregar meloxicam alcalinizando la solución con hidróxido de sodio hasta su completa disolución, añadir polisorbato 80 y agitar para homogeneizar. El meloxicam así solubilizado se mezcla con una solución acarreadora resultando en una solución oftálmica útil en el tratamiento de diversas afecciones oculares.

Se hace referencia a los siguientes documentos:

D1: US 2003055051 A 20.03.2003
D2: US 6284269 B 04.09.2001

El documento D1 se refiere a una solución acuosa oftálmica que se obtiene disolviendo meloxicam (en concentraciones del 0.01 – 6%) en una solución acuosa de trometamol junto con otros aditivos tales como ajustadores de pH (en cantidad suficiente), surfactantes (1%), reguladores de viscosidad (1.3%), antioxidantes, reguladores de osmolaridad y conservantes (página 4 y ejemplos 6-10).

El documento D2 divulga una composición farmacéutica de uso oftálmico que contiene meloxicam como ingrediente activo junto con agentes que incrementan la viscosidad, tensioactivos y reguladores de osmolaridad formando parte de la solución acarreadora (columnas 2 y 3).

Las composiciones divulgadas en los documentos D1 y D2 difieren de la recogida en las reivindicaciones 6 – 9 de la solicitud únicamente en los rangos de ciertos componentes adicionales incluidos en la solución acarreadora. Dado que el uso de estos componentes adicionales, tanto por su naturaleza como su proporción en la composición, es conocido en el estado de la técnica de cara a conseguir unas condiciones adecuadas en la preparación de soluciones oftálmicas, se considera que dichas reivindicaciones carecen de actividad inventiva por resultar de una selección obvia para un experto en la materia (Art. 33 (3) PCT).

Ninguno de los documentos D1 y D2 divulga un procedimiento de solubilización del meloxicam mediante mezcla con alcohol etílico y metilidenglicerol, alcalinización de la solución, adición de polisorbato y posterior homogeneización como el recogido en las reivindicaciones 1- 5 de la solicitud. En consecuencia, se considera que dichas reivindicaciones cumplen los requisitos de novedad, actividad inventiva y aplicación industrial según los Art. 33 (2), (3) y (4) PCT.

VIII. Observaciones relativas a la solicitud internacional

Se formulan las observaciones siguientes sobre la claridad de las reivindicaciones, de la descripción y de los dibujos y sobre si las reivindicaciones se fundan totalmente en la descripción:

Falta de claridad (Art. 6 PCT):

- el término "aproximadamente" (reivindicación 1) asociado a rango de valores es vago e impreciso de forma que es difícil determinar el alcance exacto de la protección solicitada.
- el uso término comercial "Sophisen" en las reivindicaciones 5 y 6 de la solicitud, sin existir en la solicitud la adecuada relación de los componentes de dicha solución acarreadora, da lugar a una falta de claridad en la medida en que deja al lector en duda sobre el significado de los elementos técnicos a los que se refiere.

1.- Método para solubilizar el meloxicam para preparar una solución oftálmica para el tratamiento de diversas afecciones oculares, dicho método
 5 comprende:

a) colocar en un vaso de precipitado 1000 mL de alcohol etílico y 1000 mL de metiliden, e iniciar la agitación a $500 \text{ rpm} \pm 50 \text{ rpm}$;

b) agregar aproximadamente de 15 a 30 g de meloxicam, y alcalinizar la solución con hidróxido de sodio;

10 c) esperar a que se disuelva por completo y agregar 500 mL de polisorbato 80; y

d) agitar por aproximadamente 5 minutos para que se homogeneice la solución.

2.- Método para solubilizar el meloxicam para preparar una solución oftálmica para el tratamiento de diversas afecciones oculares, dicho método
 15 comprende:

a) colocar en un vaso de precipitado 2000 mL de alcohol etílico, se inicia agitación a $500 \text{ rpm} \pm 50 \text{ rpm}$;

b) agregar 50 g de meloxicam, alcalinizando la solución con
 20 hidróxido de sodio 4N, hasta que se disuelva por completo el meloxicam;

c) Agregar 500 mL de polisorbato 80 y agitar por aproximadamente 5 minutos para que se homogeneice la solución.

3.- Método para preparar una solución oftálmica acuosa de meloxicam para usarse en el tratamiento de diversas afecciones oculares, dicho método
 25 comprende: mezclar el meloxicam solubilizado como en la reivindicación 1 o 2 con una solución acarreadora, y completar el volumen a 100 L con agua purificada mientras se agita la mezcla constantemente hasta homogeneización.

- 4.- Método para preparar una solución oftálmica acuosa de meloxicam de acuerdo con la reivindicación 3, en el que después de mezclar la solución de meloxicam y la solución acarreadora se continúa la agitación de 500 a 550 rpm por aproximadamente una hora.
- 5 5.- El método de la reivindicación 3, en el que la solución acarreadora es Sophisen®.
- 6.- Una solución farmacéutica oftálmica acuosa que comprende meloxicam y Sophisen®.
- 7.- La solución oftálmica acuosa de la reivindicación 6, que incluye
10 además uno o más conservadores para dar el efecto antimicrobiano.
- 8.- La solución oftálmica acuosa de la reivindicación 6, que incluye además un agente antioxidante que se selecciona del grupo que consiste de edetato disódico, metabisulfito de sodio, bisulfito de sodio, acetilcisteína, tiosulfato de sodio y tiourea.
- 15 9.- Una solución farmacéutica oftálmica acuosa que comprende:
- 0.001 a 0.1 % de meloxicam;
 - 0.001 a 5.0% de un sistema amortiguador de pH;
 - 0.05 a 5.0% de uno o más agentes que incrementan la viscosidad;
 - 0.01% al 10.0% de uno o más agentes tensoactivos;
 - 20 0.005% al 0.3% de uno o más agentes antioxidantes;
 - uno o más agentes reguladores de osmolaridad en concentraciones equivalentes a cloruro de sodio de 0.6% a 1.8%; y
 - uno o más conservadores para dar el efecto antimicrobiano.